

# PATENT ABSTRACTS OF JAPAN

(11)Publication number : 2000-281563  
(43)Date of publication of application : 10.10.2000

(51)Int.CI. A61K 9/08  
A61K 47/16

(21)Application number : 11-086186 (71)Applicant : ASAHI CHEM IND CO LTD  
(22)Date of filing : 29.03.1999 (72)Inventor : FUKUDA KUNIO

## (54) LIQUID FOR OPHTHALMOLOGY

### (57)Abstract:

**PROBLEM TO BE SOLVED:** To provide a liquid for ophthalmology useful as eye drops excellent in effect of preventing cornea and conjunctive surfaces and contact lens surface from being dried and also in sustainability of the effect, and as an auxiliary agent for ophthalmological operation.

**SOLUTION:** This liquid for ophthalmology contains 0.01 to 10% of trimethyl glycine, and has an osmotic pressure of 200 to 700 mOsm.

## LEGAL STATUS

[Date of request for examination]

[Date of sending the examiner's decision of rejection]

[Kind of final disposal of application other than the examiner's decision of rejection or application converted registration]

[Date of final disposal for application]

[Patent number]

[Date of registration]

[Number of appeal against examiner's decision of rejection]

[Date of requesting appeal against examiner's decision of rejection]

[Date of extinction of right]

Copyright (C); 1998,2003 Japan Patent Office

4

(19) 日本国特許庁 (JP)

(12) 公開特許公報 (A)

(11) 特許出願公開番号

特開2000-281563

(P 2 0 0 0 - 2 8 1 5 6 3 A)

(43) 公開日 平成12年10月10日 (2000. 10. 10)

(51) Int. Cl. 7

A61K 9/08  
47/16

識別記号

F I

A61K 9/08  
47/16

コード (参考)

4C076

審査請求 未請求 請求項の数 2 O L (全3頁)

(21) 出願番号 特願平11-86186

(22) 出願日 平成11年3月29日 (1999. 3. 29)

(71) 出願人 000000033

旭化成工業株式会社

大阪府大阪市北区堂島浜1丁目2番6号

(72) 発明者 福田 邦雄

神奈川県横浜市磯子区東町15-32 旭化成  
アイミー株式会社内

(74) 代理人 100068238

弁理士 清水 猛 (外3名)

F ターム(参考) 4C076 AA12 BB24 CC10 DD19 DD22  
DD25 DD26 DD51 FF31

(54) 【発明の名称】眼科用液剤

(57) 【要約】

【課題】 角結膜表面およびコンタクトレンズ表面の乾燥防止性能、およびその持続性に優れた点眼剤、さらには眼科手術用補助剤として用いることができる眼科用液剤を提供する。

【解決手段】 トリメチルグリシンを0.01~10%含有してなり、さらにはその浸透圧が200~700mOsmである眼科用液剤である。

## 【特許請求の範囲】

【請求項1】 トリメチルグリシンを0.01～10%含有してなる眼科用液剤。

【請求項2】 トリメチルグリシンを0.01～10%含有し、その浸透圧が200～700mOsmである眼科用液剤。

## 【発明の詳細な説明】

## 【0001】

【発明の属する技術分野】本発明は、眼科用液剤に関する。さらに詳しくは、眼の乾燥感の緩和あるいはコンタクトレンズ装用に伴う乾燥感、異物感等の不快感の緩和、ならびに角膜表層保護や眼科手術補助剤としても用いることができる眼科用液剤に関する。

## 【0002】

【従来の技術】涙液減少症の人の角結膜表面の乾燥、コンタクトレンズ装用者のレンズ表面の乾燥あるいはOA機器の操作中に起きる眼の乾燥などにより、疲労感、異物感を始めとして種々の症状を訴える人が増えており、生理食塩水を主剤とした人工涙液、ヒドロキシエチルセルロースを含む点眼液、ヒアルロン酸を含む点眼液などが使用されている。また、ヒアルロン酸液剤は眼科手術用補助剤としても使用されている。しかし、生理食塩水を主剤とした人工涙液あるいはヒドロキシエチルセルロースを含む点眼液は、その効果の持続性が一時的で、煩雑な点眼が必要であり、実用上煩雑であるという欠点がある。ヒアルロン酸は分子量が高く溶解しにくく、高純度あるいは高濃度液剤を作成しにくく、また、高価であり実用上手軽に使えない欠点がある。

## 【0003】

【発明が解決しようとする課題】本発明は、角結膜表面およびコンタクトレンズ表面の乾燥防止性能、およびその持続性に優れた点眼液、さらには眼科手術用補助剤として用いることができる眼科用液剤を提供することを目的とする。

## 【0004】

【課題を解決するための手段】本発明者は、トリメチルグリシンを含有する眼科用液剤が、眼の角結膜表面およびコンタクトレンズ表面の乾燥防止に効果があり、かつ、効果の持続性に優れていること、また、ヒアルロン酸より乾燥防止性能、すなわち、保水性能の優れた液剤を作ることができることを見出し、本発明をなすに至った。すなわち、本発明は、トリメチルグリシンを0.01～10%含有してなる眼科用液剤である。また、本発明は、トリメチルグリシンを0.01～10%含有し、その浸透圧が200～700mOsmである眼科用液剤である。

【0005】本発明で用いられるトリメチルグリシンは天然物質であり、広い範囲の動植物に含まれており、例えば、砂糖大根のほか、麦芽、茸類、果実、特にアカザ科の植物に多く含まれ、動物ではエビ、カニ、蛸など

に、また、人の肝臓にも含まれている。本発明の眼科用液剤において、トリメチルグリシンの含有量は0.01～10%であることが好ましい。トリメチルグリシンの含有量が0.01%未満では、所望とする効果が期待できず、また、トリメチルグリシンの含有量が10%を超えるても、その効果が増大することはないので、10%を超える含有量とする必要はない。

【0006】本発明の眼科用液剤には、塩化ナトリウム、塩化カリウム、重炭酸ナトリウム、磷酸ナトリウム、磷酸2水素ナトリウム、ホウ酸ナトリウム、ホウ酸などの当張液成分およびpH調整成分を加えることができ、これらの追加成分の調整により、浸透圧を200～700mOsmにすることが好ましい。浸透圧がこの範囲を外れると、点眼時のさし心地が悪くなる。さらにはポリエチレングリコール、ヒドロキシエチルセルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、ポリビニルアルコール、ヒアルロン酸などの増粘剤を3%程度以下、防腐剤、殺菌剤あるいは抗生物質などを加えることができる。

## 【0007】

【発明の実施の形態】次に、実施例により本発明をさらに詳細に説明する。

【実施例1】トリメチルグリシン〔旭化成工業(株)製商品名アミノコート〕5g、磷酸2水素ナトリウム0.273g、磷酸1水素ナトリウム0.582gを精製水94.15gに溶解させ、無色透明な液剤を得た。この液剤のpH値は7.2であり、浸透圧は630mOsmであった。

【実施例2】トリメチルグリシン〔旭化成工業(株)製商品名アミノコート〕1.994g、磷酸2水素ナトリウム0.018g、ホウ酸1.200g、炭酸ナトリウム0.006gを精製水96.78gに溶解させ、無色透明な液剤を得た。この液剤のpH値は6.8であり、浸透圧は400mOsmであった。

## 【0008】

【比較例1】メチルセルロース2%含有する(株)日本点眼薬研究所製商品名メトール2%。

【比較例2】ヒアルロン酸ナトリウム0.3%含有する参天製薬(株)製商品名ヒアレンミニ0.3。なお、ヒアルロン酸ナトリウムを精製水に5%溶解させた溶液は、粘度が高すぎて点眼液に適さなかった。

【0009】実施例および比較例の保水性能の評価結果は次のとおりであり、実施例は優れた保水性を有することを示した。また、家兎眼を用いた眼粘膜刺激性試験において、実施例1および2共に「陰性」であった。  
保水性能試験方法：実施例1、2で得られた液剤および比較例1、2の液剤それぞれ2mlを200mlビーカーに採取して室内に放置し、水分蒸発などの経過観察を行った。

保水性能試験結果：30時間後、比較例1および2は水

分が蒸発してしまい、薄い膜状に変化してしまったが、実施例1および2共に液状を保持し、また、40時間経過後も液状を保持していた。

【0010】

【発明の効果】本発明の眼科用液剤は、前記保水性能試験結果から明らかのように、角結膜表面およびコンタクトレンズ表面の乾燥防止性能と、その持続性に極めて優れている。